

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 2 年 10 月 22 日 (2020.10.22)

【公表番号】特表 2019-529408 (P2019-529408A)

【公表日】令和 1 年 10 月 17 日 (2019.10.17)

【年通号数】公開・登録公報 2019-042

【出願番号】特願 2019-514208 (P2019-514208)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5578 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/5578

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/10

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 1 2

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 9 月 8 日 (2020.9.8)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

予備製剤であって、

- a) モノ -、ジ - またはトリ - アシル脂質のうちの少なくとも 1 つを 20 ~ 80 重量% ;
- b) 任意選択で、少なくとも 1 つのリン脂質 ;
- c) 少なくとも 1 つの生体適合性有機溶媒を 1 ~ 30 重量% ; 及び

d) トレプロスチニルまたはその塩

を含み、少なくとも等体積量の水性流体と接触すると、少なくとも1つの液晶相構造を形成する前記予備製剤。

【請求項2】

成分d)を前記トレプロスチニル遊離酸に基づき0.1~10%、好ましくは0.2~6%、例えば0.2~5%、特に0.2~4%含む、請求項1に記載の予備製剤。

【請求項3】

成分d)がトレプロスチニル(TPN)塩、好ましくはトレプロスチニルナトリウム塩を含むか、またはそれからなる、請求項1または2に記載の予備製剤。

【請求項4】

成分a)が中性ジアシル及び/またはモノアシル脂質、ジアシルグリセロール、例えばジオレイン酸グリセロール(GDO)、またはモノアシルヘキシタンを含むか、またはそれからなる、請求項1~3のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項5】

成分a)を35~55重量%、好ましくは38~52重量%、特に40~50重量%含む、請求項1~4のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項6】

成分b)が、ホスファチジルコリン(PC)、ホスファチジルエタノールアミン(PE)またはホスファチジイルノシトール(PI)、好ましくはPCを含むか、またはそれからなる、請求項1~5のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項7】

成分b)を30~60重量%、好ましくは35~55重量%、特に38~52重量%、特に40~50重量%含む、請求項1~6のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項8】

成分c)が、アルコール、アミン、アミド、スルホキシド及び/またはエステルからなる群から選択される少なくとも1つの溶媒を含むか、またはそれからなる；または

成分c)がモノ-アルコール溶媒を含むか、またはそれからなる；または

成分c)がエタノール、プロパノール、イソプロパノール、ベンジルアルコールまたはそれらの混合物を含むか、またはそれからなる
請求項1~7のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項9】

成分c)がエタノールまたはエタノール及びプロピレングリコールの混合物を含むか、またはそれからなり、好ましくはエタノールとPGとの比が1:1~10:1、より好ましくは1.5:1~8:1、最も好ましくは2:1~5:1(例えば、ほぼ3:1)である、請求項8に記載の予備製剤。

【請求項10】

成分c)が2~20重量%、好ましくは5~15重量%のレベルで存在する、請求項1~9のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項11】

成分a:bの比が40:60~60:40の範囲、特に45:55~55:45の範囲である、請求項1~10のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項12】

20で100~700mPa sの粘度を有する、請求項1~11のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項13】

成分a)が大豆PCを含む；

成分b)がGDOを含む；

成分c)がエタノールを含む；

成分d)がトレプロスチニル(TPN)またはその塩、好ましくはTPN(Na)である、

請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項 1 4】

P G、D M S O または N M P からなる群から選択される共溶媒をさらに含み、エタノール：共溶媒の比が 3 0 : 7 0 ~ 7 0 : 3 0 (w / w) の範囲内である、請求項 1 3 に記載の予備製剤。

【請求項 1 5】

医薬品として使用するための、請求項 1 ~ 1 4 のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項 1 6】

肺動脈高血圧症 (P A H)、重症 P A H、レイノー病、虚血及び関連状態から選択される少なくとも 1 つの状態を解消するために、それを必要とするヒトの対象を処置するために用いられる、請求項 1 ~ 1 4 のいずれかに記載の予備製剤。

【請求項 1 7】

投与経路が静脈内ではない；または

前記投与経路が浅皮下もしくは深皮下注射、局所または口腔内である

請求項 1 6 に記載の予備製剤。

【請求項 1 8】

1 ~ 6 0 日ごとに、好ましくは 1、2、3、7、1 4、2 1、2 8、3 0、または 6 0 日ごとに (いずれの場合でも例えばその ± 1 日、± 3 日、または 2 0 % ごとに)、最も好ましくは 7 (± 1) 日ごとに、または 1 4 (± 2) 日ごとに、または 3 0 (± 3) 日ごとに、それを必要とするヒトに投与するために用いられる、請求項 1 6 または 1 7 に記載の予備製剤。

【請求項 1 9】

請求項 1 ~ 1 4 のいずれかに記載の予備製剤を含有する、プレフィルド投与デバイス。

【請求項 2 0】

請求項 1 ~ 1 8 のいずれかに記載の予備製剤 1 m L を含む、請求項 1 9 に記載のプレフィルド投与デバイス。